

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference 0000055285	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/EP2005/000379	International filing date (day/month/year) 15 January 2005 (15.01.2005)	Priority date (day/month/year) 27 January 2004 (27.01.2004)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant BASF Aktiengesellschaft			

1. This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a).

2. This REPORT consists of a total of 9 sheets, including this cover sheet.

In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.

3. This report contains indications relating to the following items:

- | | |
|---|---|
| <input checked="" type="checkbox"/> Box No. I | Basis of the report |
| <input type="checkbox"/> Box No. II | Priority |
| <input type="checkbox"/> Box No. III | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability |
| <input type="checkbox"/> Box No. IV | Lack of unity of invention |
| <input checked="" type="checkbox"/> Box No. V | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement |
| <input type="checkbox"/> Box No. VI | Certain documents cited |
| <input type="checkbox"/> Box No. VII | Certain defects in the international application |
| <input type="checkbox"/> Box No. VIII | Certain observations on the international application |

4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).

Date of issuance of this report 27 July 2006 (27.07.2006)	
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Yolaine Cussac
Facsimile No. +41 22 338 82 70	e-mail: pt11@wipo.int

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

An:

siehe Formular PCT/ISA/220

SCHRIFTLICHER BESCHIED DER
INTERNATIONALEN
RECHERCHENBEHÖRDE
(Regel 43bis.1 PCT)

Absenddatum
(Tag/Monat/Jahr) siehe Formular PCT/ISA/210 (Blatt 2)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
siehe Formular PCT/ISA/220

WEITERES VORGEHEN
siehe Punkt 2 unten

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000379

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
15.01.2005

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
27.01.2004

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK
A01N43/90

Anmelder
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

1. Dieser Bescheid enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids
- ☐ Feld Nr. II Priorität
- ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

2. WEITERES VORGEHEN

Wird ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt, so gilt dieser Bescheid als schriftlicher Bescheid der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde ("IPEA"); dies trifft nicht zu, wenn der Anmelder eine andere Behörde als diese als IPEA wählt und die gewählte IPEA dem internationale Büro nach Regel 66.1bis b) mitgeteilt hat, daß schriftliche Bescheide dieser internationalen Recherchenbehörde nicht anerkannt werden.

Wenn dieser Bescheid wie oben vorgesehen als schriftlicher Bescheid der IPEA gilt, so wird der Anmelder aufgefordert, bei der IPEA vor Ablauf von 3 Monaten ab dem Tag, an dem das Formblatt PCT/ISA/220 abgesandt wurde oder vor Ablauf von 22 Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft, eine schriftliche Stellungnahme und, wo dies angebracht ist, Änderungen einzureichen.

Weitere Optionen siehe Formblatt PCT/ISA/220.

3. Nähere Einzelheiten siehe die Anmerkungen zu Formblatt PCT/ISA/220.

Name und Postanschrift der mit der internationalen
Recherchenbehörde



Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340 - 3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Muelliners, W

Tel. +31 70 340-3289



Feld Nr. I Grundlage des Bescheids

1. Hinsichtlich der **Sprache** ist der Bescheid auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache erstellt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bescheid ist auf der Grundlage einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache erstellt worden, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (gemäß Regeln 12.3 und 23.1 b)).
2. Hinsichtlich der **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz**, die in der internationalen Anmeldung offenbart wurde und für die beanspruchte Erfindung erforderlich ist, ist der Bescheid auf folgender Grundlage erstellt worden:
 - a. Art des Materials
 - ☐ Sequenzprotokoll
 - ☐ Tabelle(n) zum Sequenzprotokoll
 - b. Form des Materials
 - ☐ in schriftlicher Form
 - ☐ in computerlesbarer Form
 - c. Zeitpunkt der Einreichung
 - ☐ in der eingereichten internationalen Anmeldung enthalten
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht
 - ☐ bei der Behörde nachträglich für die Zwecke der Recherche eingereicht
3. ☐ Wurden mehr als eine Version oder Kopie eines Sequenzprotokolls und/oder einer dazugehörigen Tabelle eingereicht, so sind zusätzlich die erforderlichen Erklärungen, daß die Information in den nachgereichten oder zusätzlichen Kopien mit der Information in der Anmeldung in der eingereichten Fassung übereinstimmt bzw. nicht über sie hinausgeht, vorgelegt worden.
4. Zusätzliche Bemerkungen:

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der
erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur
Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung

Neuheit	Ja: Ansprüche 1-10 Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit	Ja: Ansprüche 1-10 Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ja: Ansprüche: 1-10 Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V.

Es wird auf die folgenden im internationalen Recherchenbericht zitierten
Entgegenhaltungen (D1-D7) verwiesen:

- D1: EP-A-0 988 790
- D2: WO 98/46607 A
- D3: WO 03/073850 A
- D4: US-B1-6 268 371
- D5: US-A-5 593 996
- D6: EP-A-0 193 922
- D7: EP-A-0 737 421

Neuheit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist neu (Artikel 33(1) und (2) PCT).

Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 sind fungizide Mischungen, insbesondere zur Bekämpfung von Reispfaden, enthaltend Tridemorph und ein spezifisches fungizides Triazolopyrimidin (im folgenden TP1 genannt) in einer synergistisch wirksamen Menge. Anspruch 3 bezieht sich auf Mittel die diese Mischungen neben einem Trägerstoff enthalten. Die übrigen unabhängigen Ansprüche 4, 9 und 10 richten sich auf ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen mittels einer solchen Mischung, auf aus einem solchen Verfahren resultierendes Saatgut, das eine solche Mischung enthält, bzw. auf die Verwendung der beiden Komponenten zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von Schadpilzen.

Keine der genannten Entgegenhaltungen offenbart die spezifischen Mischungen, die Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind.

D1 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, unter die auch TP1 fällt, mit 22 anderen Fungiziden bzw. Fungizidklassen, unter ihnen auch Fenpropimorph, wie Tridemorph ein die Ergosterolbiosynthese hemmendes cyclisches Amin, sowie Ergosterolbiosynthesehemmer mit Azolstruktur, wie z.B. Propiconazole und

Metconazole, nicht aber Tridemorph selbst. Die bevorzugten und in Beispielen benutzten Azolopyrimidine A, B und C (im Folgenden TPa, TPb bzw. TPc genannt) sind das 6-(2-Cl-6-F-Phenyl)-, das 7-(2,2,2-Trifluorethylamino)- bzw. das 7-(1,1,1-Trifluoropropyl-2-yl-amino)-Analoge des TP1.

D2 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) u.a. spezifisch die Verbindung TP1 (Beispielverbindung 2): Die Verbindung wird hinsichtlich ihrer Wirkung gegen echten Mehltau auf Weintrauben mit TPa verglichen und überlegen gefunden. Die Möglichkeit der Mischung mit anderen Fungiziden, unter denen auch Tridemorph aufgeführt wird, unter Umständen unter Erzielung eines synergistischen Effektes, wird erwähnt aber nicht realisiert.

D3 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen des Prothioconazoles mit Tridemorph, Fenpropimorph oder Fenpropidin.

D4 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von unter anderem aus D5 bekannten Triazolopyrimidinen mit Melaninbiosynthesehemmern wie Carpropamid, Pyroquilon und Fenoxanil. Diese Mischungen sind insbesondere wirksam gegen Reispflichtogene (*Piricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus*, der die Braunfleckenkrankheit verursacht). Die bevorzugten, in D4 als Azolopyrimidine A, C und D bezeichneten, Triazolopyrimidine sind TPa, TPb bzw. TPc.

D5 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) bestimmte fungizide Triazolopyrimidine, darunter TPa. Die Wirkung gegen *Piricularia oryzae* auf Reis wird demonstriert (siehe D5, Beispiele 225 und 226).

D6 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen der Alkylmorpholin-Fungizide Tridemorph, Fenpropimorph, Dodemorph und Aldimorph mit Acylalanin-Fungiziden, wie z.B. Furalaxyl und Benalaxyl, die üblicherweise zur Bekämpfung von Oomyceten eingesetzt werden.

D7 schließlich offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten

Passagen) synergistische fungizide Mischungen bestimmter Strobilurine, wie z.B. Dimoxystrobin und Metominostrobin, mit Azolen, wie z.B. Propiconazole und Metconazole, oder zyklischen Aminen, wie z.B. Tridemorph, Fenpropimorph und Fenpropidin.

Erfinderische Tätigkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 beruht auf einer erfinderischen Tätigkeit (Artikel 33(1) und (3) PCT).

Im Lichte der Beschreibung und des nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden angesehen werden, insbesondere solche die sich zur Bekämpfung von Reispathogenen eignen, das heißt, die eine hohe Systemik mit einer guten Wirksamkeit gegen Pathogene wie *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus* vereinen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit dem bekannten Fungizid Tridemorph einem zyklischen Amin gekennzeichnet.

In Anbetracht des oben dargelegten Standes der Technik ist diese Kombination keine naheliegende Lösung der Aufgabe.

In D1 werden Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, die sowohl TPa, TPb und TPc als auch TP1 umfasst mit anderen Fungiziden offenbart (siehe oben). Getestet werden die synergistischen Mischungen auf einer Anzahl von Schadpilzen, wie Arten der Gattungen *Blumeria*, *Botrytis*, *Septoria*, *Erysiphe* und *Puccinia*, nicht aber auf eines der typischen Reispathogene. Auch werden die Tests auf verschiedenen Nutzpflanzen, wie Weizen, Gerste, Äpfel, Gurken, Tomaten und Weinreben nicht aber Reis vorgenommen. Die der in der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagenen Mischung am nächsten kommende Mischung aus TPa und Tridemorph (siehe D1, Beispiel 1) wird gegen Blattbräune (*Leptosphaeria nodorum*, synonym *Phaeosphaeria n.*, Anamorph: *Septoria n.* / *Stagonospora n.*) auf Weizen getestet.

In D2 wird betont, dass die dort offenbaren 6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-triazolopyrimidine (wie z.B. TP1) gegenüber den aus D5 bekannten Triazolopyrimidinen (wie z.B. TPa und TPc) erhöhte Systemik und fungitoxische Wirkung gegen Reispathogene haben (siehe D2, Seite 7, Zeilen 9-11). Die gute Wirksamkeit speziell des TP1 gegen *Pyricularia oryzae* (= *Pyricularia grisea* f. sp. *oryzae*, Teleomorph: *Magnaporthe* gr. f. sp. *oryzae*) und *Rhizoctonia solani* wird in Beispielen gezeigt (siehe D2, Tabelle II).

In D2 wird auch eine Mischung mit anderen Fungiziden vorgeschlagen, darunter auch mit Tridemorph, die möglicherweise zu einem synergistischen Effekt führen könne (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D2).

Aus D4 (siehe oben) sind synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen darunter TPa und TPc mit anderen von Tridemorph deutlich verschiedenen Fungiziden insbesondere zur Bekämpfung von Reispathogenen bekannt.

Auch aus der Entgegenhaltung D5 sind Verbindungen einer allgemeinen Formel, die sowohl TPa, TPb und TPc als auch TP1 umfasst, als wirksam gegen Reispathogene bekannt, so wird dort z.B. die Wirksamkeit des TPa (Verbindung 139, in D5) gegen *Pyricularia oryzae* beispielhaft demonstriert (siehe Beispiel 226).

Um jedoch ausgehend von D1 zur erfindungsgemäßen Kombination zu gelangen ist es notwendig eines der dort bevorzugten Triazolopyrimidine, z.B. TPc spezifisch durch das neben anderen Triazolopyrimidinen in D2 erwähnte TP1 zu ersetzen. Obendrein müsste man auch das dort verwendete Fenpropimorph gegen Tridemorph austauschen.

Diese Wahl ist angesichts der Aufgabe insbesondere Mittel zur Bekämpfung von Reispathogenen bereitzustellen nicht naheliegend.

Tridemorph steht nicht bekannt als besonders wirksam gegen solche Pathogene. So werden in D3 die pflanzenpathogenen Pilze, zu deren Bekämpfung diese Mischungen (siehe oben) insbesondere geeignet sind, in einer Liste angeführt, die zwar u.a. *Pyricularia oryzae* enthält und weitgehend identisch mit der der vorliegenden Anmeldung ist (vergleiche D3, Seite 5, Zeile 36 - Seite 6, Zeile 14 mit der Beschreibung Seite 2, Zeile 28- Seite 3, Zeile 5, und Seite 3, Zeilen 19, 20. Es sei ferner angemerkt, dass *Cercospora arachidicola* das Anamorph zu *Mycosphaerella arachides* ist und *Helminthosporium*

**SCHRIFTLICHER BESCHEID
DER INTERNATIONALEN
RECHERCHEBEHÖRDE (BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/000379

oryzae, *Bipolaris oryzae* und *Drechslera oryzae* sämtlich Synonyme für die Art *Cochliobolus miyabeanus* sind.), getestet werden die Mischungen aber bezeichnenderweise nur gegen *Erysiphe (Blumeria) graminis* und *Puccinia recondita* auf Weizen.

D6 führt aus (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen), dass Morpholinfungizide zur Bekämpfung von echtem Mehltau eingesetzt werden, und die dort offenbarten synergistischen Mischungen werden dann auch nicht gegen typische Reispfropthogene sondern gegen *Phytophthora* und *Plasmopara* getestet.

Auch die aus D7 bekannten Mischungen werden bezeichnenderweise nur gegen Rost und echten Mehltau auf Weizen und Gurken getestet.

Erst recht konnte nicht erwartet werden, dass die vorgeschlagenen Mischungen sogar, wie in der Anmeldung gezeigt, eine synergistisch gesteigerte Wirkung gegen das Reispfropthogen *Cochliobolus miyabeanus* zeigen würden.

Die vorgeschlagene Lösung das Triazolopyrimidin TP1 mit Tridemorph zu kombinieren ist deshalb nicht naheliegend.

Industrielle Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) and (4) PCT).